

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2001 年 10 月 4 日 (04.10.2001)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 01/72738 A1(51) 国際特許分類<sup>7</sup>: C07D 401/04, A61K  
31/4709, A61P 31/04 // C07M 7:00

(21) 国際出願番号: PCT/JP01/02761

(22) 国際出願日: 2001 年 3 月 30 日 (30.03.2001)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2000-97690 2000 年 3 月 31 日 (31.03.2000) JP  
特願2000-271231 2000 年 9 月 7 日 (07.09.2000) JP(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 第一  
製薬株式会社 (DAIICHI PHARMACEUTICAL CO.,  
LTD.) [JP/JP]; 〒103-8234 東京都中央区日本橋3丁目  
14番10号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 竹村 真 (TAKE-  
MURA, Makoto) [JP/JP]. 高橋 寿 (TAKAHASHI,  
Hisashi) [JP/JP]. 川上勝浩 (KAWAKAMI, Katsuhiko)  
[JP/JP]. 伊藤雅夫 (ITO, Masao) [JP/JP]. 鈴木徹也 (SUZUKI, Tetsuya) [JP/JP]. 大谷 剛 (OHTANI,  
Tsuyosi) [JP/JP]. 関口正保 (SEKIGUCHI, Masayasu)  
[JP/JP]. 宮内理江 (MIYAUCHI, Rie) [JP/JP]. 早川勇夫  
(HAYAKAWA, Isao) [JP/JP]; 〒134-8630 東京都江戸川  
区北葛西1丁目16-13 第一製薬株式会社 東京研究開  
発センター内 Tokyo (JP).(74) 代理人: 有賀三幸, 外 (ARUGA, Mitsuyuki et al.); 〒  
103-0013 東京都中央区日本橋人形町1丁目3番6号 共  
同ビル Tokyo (JP).(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,  
BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK,  
DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID,  
IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT,  
LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ,  
PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT,  
TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW,  
MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), ユーラシア特許 (AM,  
AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ユーロッパ特許  
(AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT,  
LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG,  
CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

/続葉有/

(54) Title: QUINOLONECARBOXYLIC ACID DERIVATIVE

(54) 発明の名称: キノロンカルボン酸誘導体

(57) Abstract: (-)-7-[(7S)-7-Amino-5-azaspiro[2.4]heptan-5-yl]-6-fluoro-1-[(1R,2S)-2-fluoro-1-cyclopropyl]-1,4-dihydro-8-methoxy-4-oxo-3-quinolinecarboxylic acid monohydrochloride monohydrate and antibacterial agents containing the same. This compound is excellent in antibacterial activity and safety and highly stable to light and humidity, which makes it useful as an antibacterial agent.

(57) 要約:

(-) - 7 - [ ( 7 S ) - 7 - アミノ - 5 - アザスピロ [ 2 . 4 ] ヘプタン -  
5 - イル ] - 6 - フルオロ - 1 - [ ( 1 R , 2 S ) - 2 - フルオロ - 1 - シクロ  
プロピル ] - 1 , 4 - ジヒドロ - 8 - メトキシ - 4 - オキソ - 3 - キノリンカル  
ボン酸 1 塩酸塩 1 水和物及びこれを含有する抗菌剤。

本発明化合物は優れた抗菌活性と安全性を有し、かつ光や湿度に対する安定性  
も優れており、抗菌剤として有用である。

WO 01/72738 A1



添付公開書類:  
— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される  
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語  
のガイダンスノート」を参照。